

UNIVERSITI SAINS MALAYSIA

**Peperiksaan Semester Kedua
Sidang Akademik 1996/97**

April 1997

FIT 141 - Prinsip-prinsip Farmakokimia

Masa: 2 jam

Kertas ini mengandungi **ENAM (6)** soalan dan 12 muka surat yang bertaip.

Jawab **LIMA (5)** soalan sahaja.

Soalan 1 adalah wajib dan mesti dijawab di atas skrip yang disediakan.

Semua soalan mesti dijawab di dalam Bahasa Malaysia.

.....2/-

ANGKA GILIRAN

- I. Soalan Pilihan Berganda. Jawab semua soalan dengan menandakan (✓) pada ruang yang dikhaskan bertentangan dengan jawapan atau pernyataan yang **BETUL ATAU PALING SESUAI** bagi sesuatu soalan. Hanya **SATU** jawapan/pernyataan sahaja yang betul atau paling sesuai bagi tiap-tiap soalan. Sebahagian markah akan ditolak bagi jawapan yang salah.

1. Yang mana di antaranya merupakan antagonisme fisiologikal?

..... (A) adrenalina - noradrenalina.
..... (B) asetilkolina - noradrenalina. ✓
..... (C) asetilkolina - histamina.
..... (D) asetilkolina - bradikinin.

2. Kadar penyerapan drug melalui saluran oral biasanya mengikuti urutan berikut:

..... (A) tablet < kapsul < serbuk < larutan < ampaian.
..... (B) tablet < kapsul < ampaian < serbuk < larutan.
..... (C) tablet < serbuk < kapsul < ampaian < larutan.
..... (D) tablet < kapsul < serbuk < ampaian < larutan. ✓

.....3/-

ANGKA GILIRAN

3. Yang mana pernyataan bersabit dengan ikatan drug-protein adalah tidak benar?
- (A) Drug tidak mempunyai kesan farmakologi
 - (B) Drug tidak mengalami biotransformasi.
 - (C) $T_{1/2}$ drug berkenaan dipanjangkan
 - (D) $T_{1/2}$ drug berkenaan dikurangkan.
4. Yang mana di antara nilai di bawah dapat mencerminkan paras keselamatan sesuatu drug?
- (A) LD_{50}
 - (B) ED_{50}
 - (C) Efikasi.
 - (D) Indeks terapeutik.
5. Cerakinan biologikal tidak perlu dijalankan untuk
- (A) insulin.
 - (B) oksitosin.
 - (C) heparin.
 - (D) aspirin.

.....4/-

ANGKA GILIRAN

6. Kajian ketoksikan akut haiwan melibatkan.
- (A) penentuan LD₅₀ dan kajian dos tunggal berperingkat.
 - (B) penentuan LD₅₀ dan kajian karsinogenisiti.
 - (C) penentuan LD₅₀ dan kajian teratogenisiti.
 - (D) penentuan LD₅₀ dan kajian farmakodinamik.
7. Penyerapan semula penisilin pada tubul distal nefron ditingkatkan dengan pemberian bersama
- (A) probenamid.
 - (B) morfina.
 - (C) petidina.
 - (D) dopamina.
8. Pilih pasangan yang betul mengenai asal-usul drug.
- (A) Insulin melalui bioteknologi.
 - (B) Progesterone melalui pengekstrakan tumbuhan.
 - (C) Morfina melalui sintesis.
 - (D) Amfetamina melalui semisintesis.

.....5/-

ANGKA GILIRAN

9. Pilih pernyataan yang betul.

Penukargantian isosterik

- (A) digunakan dalam reka bentuk drug antimetabolit.
- (B) jarang digunakan dalam modifikasi drug.
- (C) melibatkan isoster menurut Erlenmeyer sahaja.
- (D) ialah $>C = O$ diganti dengan $-COOH$.

10. Pilih pernyataan yang betul.

Bioprekursor

- (A) mengambil kira fasa 1 metabolisme drug.
- (B) terlibat dalam tindak balas yang membawa perubahan dalam keadaan pengoksidaan drug.
- (C) tidak mengakibatkan transformasi moiti spesifik dalam molekul substrat.
- (D) tidak melibatkan pembentukan kumpulan berfungsi yang baru.

.....6/-

ANGKA GILIRAN

11. Pilih jawapan yang betul.

Analisis Cluster adalah

- (A) berdasarkan kaedah Hansch.
- (B) berasaskan rumusan Schrödinger.
- (C) melibatkan teknik kepintaran buatan.
- (D) menggunakan data spektroskopik.

12. Pilih jawapan yang tidak betul.

Parameter kelarutan mencakupi

- (A) tegangan permukaan.
- (B) pKa.
- (C) pengionan.
- (D) LEMO.

13. Pilih pernyataan yang tidak betul.

Kelebihan modifikasi molekul adalah,

- (A) kemungkinan tinggi mendapatkan drug.
- (B) drug akan lebih murah.
- (C) maklumat membantu menerangkan kaitan struktur dan aktiviti.
- (D) kepelbagaian cara esei biologi.

.....7/-

ANGKA GILIRAN

14. Pilih jawapan yang tidak betul.

Benorilat adalah cantuman aspirin dan asetaminofen merupakan contoh

- (A) kacukan molekul.
- (B) replikasi molekul.
- (C) penambahan molekul.
- (D) asosiasi molekul.

15. Pilih jawapan yang tidak betul.

Pengenalan ikatan dobel ke dalam molekul drug memberikan kesan

- (A) perubahan stereokimia drug.
- (B) perubahan aktiviti drug.
- (C) pengubahan ciri-ciri fizikokimia.
- (D) seperti pusat kiral.

16. Pilih pernyataan yang tidak betul mengenai drug lunak.

- (A) Eliminasi pembentukan bahan antara yang toksik.
- (B) Membentuk metabolit aktif.
- (C) Tiada interaksi drug dengan sistem enzim.
- (D) Masalah farmakokinetik lebih mudah.

.....8/-

ANGKA GILIRAN

17. Pilih pernyataan yang tidak betul.

Prodrug ialah

- (A) ikatan di antara molekul drug dan moiti pembawa melalui ikatan van der Waals.
- (B) tidak reaktif atau kurang aktif berbanding drug induk.
- (C) ikatan di antara drug dan moiti pembawa harus dipisah *in-vivo*.
- (D) di mana moiti pembawa yang terlepas harus tak toksik dan tak aktif.

18. Pilih pernyataan yang tidak betul.

Drug bersasaran

- (A) merupakan bentuk pendam bahan bioaktif.
- (B) disediakan dengan menggabungkan drug dengan pembawa khusus.
- (C) bertujuan memastikan interaksi drug dengan sasaran secara spesifik.
- (D) melibatkan sistem pembawa daripada bahan sel makromolekul dan bahan polimer sintetik.

.....9/-

ANGKA GILIRAN

19. Pilih pernyataan yang tidak betul.

Faktor struktur dalam aktiviti drug adalah

- (A) stereokimia molekul.
- (B) jarak antara atom atau kumpulan.
- (C) taburan dan konfigurasi elektronik drug.
- (D) aktiviti termodinamik.

20. Pilih jawapan yang tidak betul.

Kaedah Penambahan Matematik bagi kajian SAR melibatkan model-model

- (A) Free-Wilson.
- (B) Fujita-Ban.
- (C) de novo.
- (D) tenaga bebas linear.

(20 markah)

.....10/-

(FIT 141)

II. Tulis nota ringkas tentang

- (A) dependens drug.
- (B) antagonisme farmakologikal.
- (C) induksi enzim mikrosom hati.
- (D) kajian ketoksian haiwan sub-akut.

(20 markah)

III. (A) Banding dan bezakan:

- (i) agonis dan agonis separa.
- (ii) potensi dan efikasi.
- (iii) tolerans dan tolerans bersilang.

(10 markah)

(B) Terangkan kaedah pengoptimuman sebatian petunjuk menurut kaedah:

- (i) Fibonacci.
- (ii) Simpleks Berjujuk.

(10 markah)

.....11/-

IV. (A) Terangkan maksud reka bentuk drug secara rasional dan berikan contoh yang terdapat pada:

- (i) agen antimetabolit.
- (ii) agen penghalang enzim.

(10 markah)

(B) Terangkan:

- (i) kaitan aktiviti termodinamik dengan tindakan drug.
- (ii) parameter kelarutan dan aktiviti drug.

(10 markah)

V. (A) Terangkan pendekatan berikut dalam kajian Hubungan Struktur dan Aktiviti (SAR).

- (i) Analisis Hansch
- (ii) Model Kimia Kuantum

(10 markah)

(B) Terangkan kesan farmakologi moiti-moiti berikut:

- (i) kumpulan nitro.
- (ii) kumpulan asid dan bes.

(10 markah)

.....12/-

(FIT 141)

VI. (A) Bincangkan:

- (i) peranan stereokimia dalam tindakan drug.
- (ii) pengikatan dalam interaksi drug-reseptor

(10 markah)

(B) Terangkan dengan contoh:

- (i) drug lunak.
- (ii) bioprekursor.

(10 markah)

oooOOOooo

